

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局(43) 国際公開日
2005 年 6 月 30 日 (30.06.2005)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 2005/058866 A1(51) 国際特許分類:
A61K 31/381 // C07B 61/00

C07D 333/22,

(74) 代理人: 三枝 英二, 外(SAEGUSA, Eiji et al); 〒
5410045 大阪府大阪市中央区道修町 1-7-1 北浜
T N K ビル Osaka (JP).

(21) 国際出願番号: PCT/JP2004/018569

(22) 国際出願日: 2004 年 12 月 13 日 (13.12.2004)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

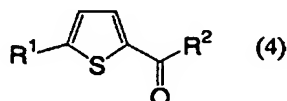
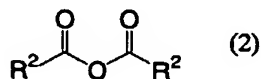
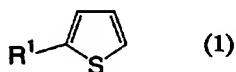
(30) 優先権データ:
特願 2003-419362
2003 年 12 月 17 日 (17.12.2003) JP(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 住友精
化株式会社 (SUMITOMO SEIKA CHEMICALS CO.,
LTD.) [JP/JP]; 〒6750145 兵庫県加古郡播磨町宮西
3 4 6 番地の 1 Hyogo (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 坂東 誠二
(BANDO, Seiji) [JP/JP]; 〒6750145 兵庫県加古郡播磨
町宮西 3 4 6 番地の 1 住友精化株式会社 精密化学
品研究所内 Hyogo (JP). 佐竹 秀三 (SATAKE, Syuzo)
[JP/JP]; 〒6750145 兵庫県加古郡播磨町宮西 3 4 6 番
地の 1 住友精化株式会社 精密化学品研究所内 Hyogo
(JP). 加賀野 宏和 (KAGANO, Hirokazu) [JP/JP]; 〒
6750145 兵庫県加古郡播磨町宮西 3 4 6 番地の 1 住
友精化株式会社 精密化学品研究所内 Hyogo (JP).(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が
可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR,
BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM,
DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU,
ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS,
LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA,
NL, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE,
SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US,
UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護
が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA,
SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ,
BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE,
BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU,
IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR),
OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML,
MR, NE, SN, TD, TG).添付公開書類:
— 国際調査報告書2 文字コード及び他の略語については、定期発行される
各 PCT ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語
のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: PROCESS FOR PRODUCING 2-ACYLTHIOPHENE COMPOUND

(54) 発明の名称: 2-アシルチオフエン化合物の製造方法

(57) Abstract: A process for producing a 2-acylthiophene compound re-
duced in the content of the 3-acyl isomer generated as a by-product. The
process, which is for producing a 2-acylthiophene compound represented
by the general formula (4): [Chemical formula 4] (4) (wherein R¹ represents
hydrogen, C₁₋₆ alkyl, phenyl, or halogeno and R² represents C₁₋₆ alkyl or
phenyl), is characterized by reacting a thiophene compound represented by
the general formula (1): [Chemical formula 1] (1) (wherein R¹ is the same
as defined above) with at least one member selected from the group consist-
ing of acid anhydrides represented by the general formula (2): [Chemical
formula 2] (2) (wherein R² is the same as defined above) and acid halides
represented by the general formula (3): [Chemical formula 3] (3) (wherein
R² is the same as defined above and X represents halogeno) in the presence
of a solid acid catalyst at a temperature lower than 75°C in the absence of
any solvent.

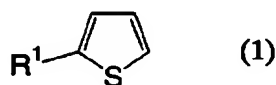


(57) 要約:

副反応生成物である3位異性体の含有量の少ない2-アシルチオフエン化合物の製造方法を提供する。

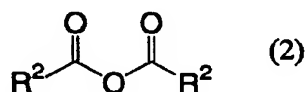
本発明は、一般式(1)；

[化1]



(式中、 R^1 は水素原子、炭素数1～6のアルキル基、フェニル基またはハロゲン原子を示す。)で表されるチオフエン化合物と、一般式(2)；

[化2]



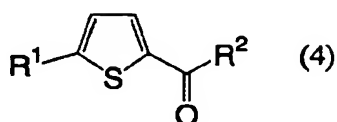
(式中、 R^2 は炭素数1～6のアルキル基またはフェニル基を示す。)で表される酸無水物および一般式(3)；

[化3]



(式中、 R^2 は前記と同様であり、 X はハロゲン原子を示す。)で表される酸ハロゲン化物からなる群より選択される少なくとも1種とを、固体酸触媒の存在下で、75℃未満、無溶媒で反応させることを特徴とする一般式(4)；

[化4]



(式中、 R^1 および R^2 は前記と同様である。)で表される2-アシルチオフエン化合物の製造方法を提供する。